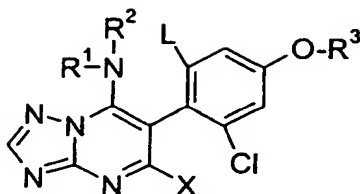


## Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

10 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

25 R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, oder Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

30 R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> tragen:

35 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedri-

ger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen  $R^b$  tragen können:

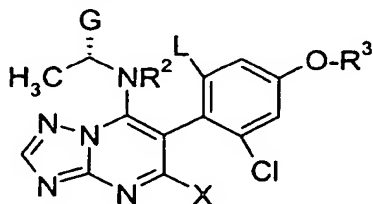
$R^b$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkoxy, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

X Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Chlor bedeutet.
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der  $R^1$  nicht Wasserstoff bedeutet.
4. Verbindungen gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.1 entsprechen:



I.1

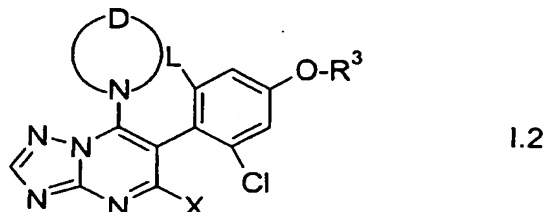
in der

45

- G C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl;  
 R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; und  
 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten  
 und L und R<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind.

5

5. Verbindungen gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.2 entsprechen:



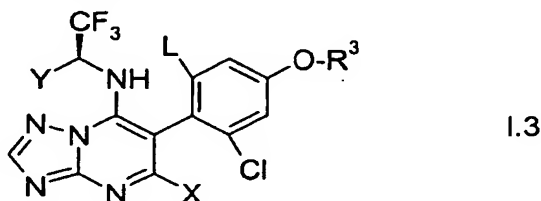
in der

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

und L und R<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind.

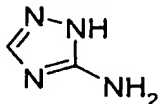
6. Verbindungen gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.3 entsprechen:



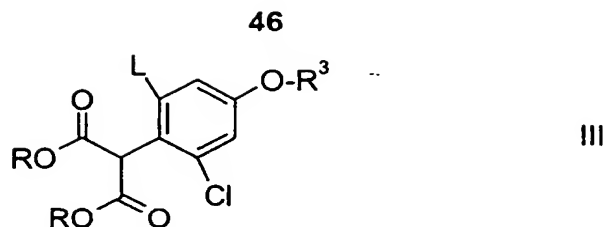
in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L und R<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind.

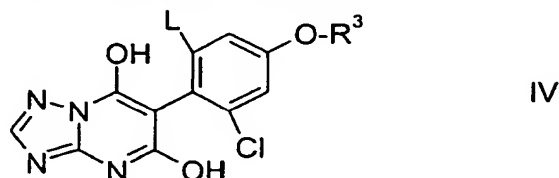
7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



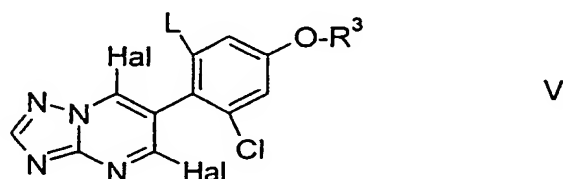
mit Phenymalonaten der Formel III



in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,



Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



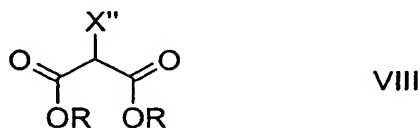
und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



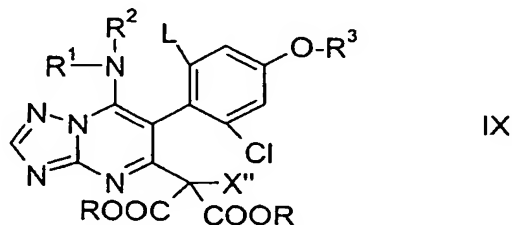
zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,



die je nach der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxyalat oder ein Halogenalkoxylat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,



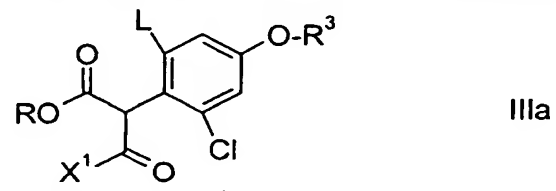
in der X'' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX



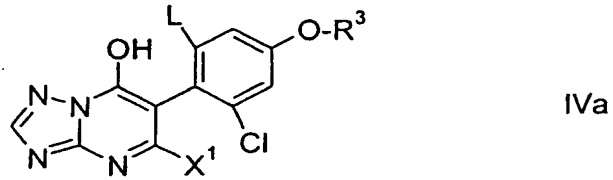
47

und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

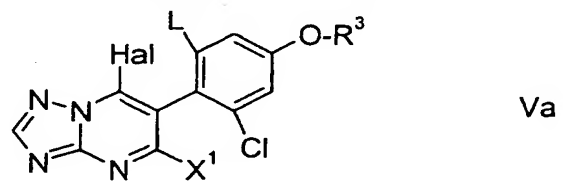
8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in  
der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von  
5 5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 7 mit Ketoestern der Formel IIIa,



in der X¹ für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl und R für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, zu  
5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel IVa



- 10 Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va

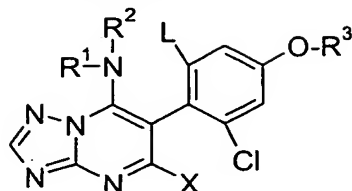


und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 7 zu Verbindungen I.

- 15 9. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 7 und 8.
10. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1
- 20 11. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.
- 25 12. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

What is claimed is:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are as defined below:

L is hydrogen, chlorine or bromine;

10 R¹, R² independently of one another are hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl or phenyl, naphthyl or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15 R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain one to three further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₃-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-alkylene and oxy-C₁-C₃-alkylenoxy;

25 R³ is C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-alkenyl, C₃-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-alkynyl, C₃-C₈-haloalkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, or phenyl-C₁-C₄-alkyl;

30 R¹ and/or R² may carry one to four identical or different groups Rᵃ:

35 Rᵃ is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-alkynyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkoxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, phenyl, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially

unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups R<sup>b</sup>:

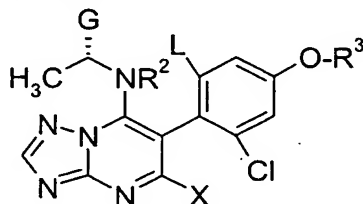
R<sup>b</sup> is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals contain 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals contain 2 to 8 carbon atoms;

and/or one to three of the following radicals:

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclyloxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to 10 ring members and the hetaryl radicals 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

X is halogen, cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalkoxy.

2. The compound of the formula I according to claim 1 in which X is chlorine.
3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2 in which R<sup>1</sup> is not hydrogen.
4. The compound according to claim 1 which corresponds to the formula I.1:



I.1

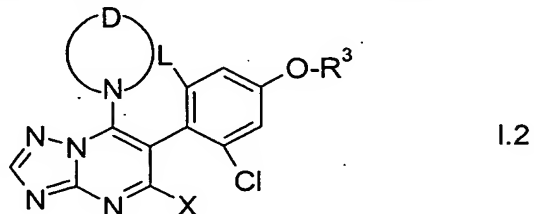
in which

G is C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxymethyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl;

AMENDED PAGE

$R^2$  is hydrogen or methyl; and  
 $X$  is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy  
 and  $L$  and  $R^3$  are as defined in claim 1.

5. The compound according to claim 1 which corresponds to the formula I.2:

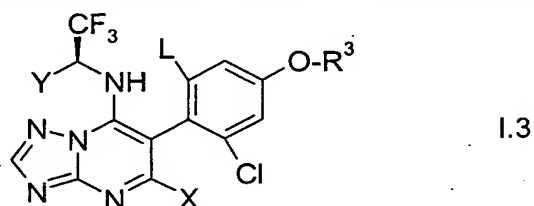


in which

$D$  together with the nitrogen atom forms a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen,  $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -alkoxy and  $C_1$ - $C_2$ -haloalkyl;

$X$  is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy  
 and  $L$  and  $R^3$  are as defined in claim 1.

6. The compound according to claim 1 which corresponds to the formula I.3:



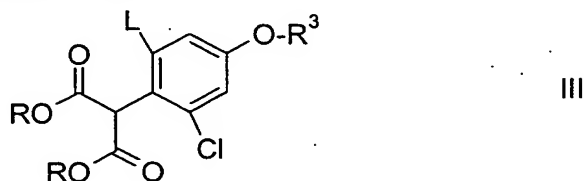
in which  $Y$  is hydrogen or  $C_1$ - $C_4$ -alkyl;

$X$  is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy and  $L$  and  $R^3$  are as defined in claim 1.

7. A process for preparing the compounds of the formula I according to claim 1 in which  $X$  is halogen, cyano,  $C_1$ - $C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -alkoxy or  $C_1$ - $C_2$ -haloalkoxy by reaction of 5-aminotriazole of the formula II



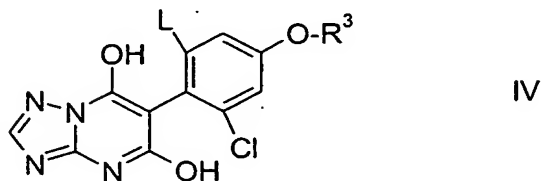
with phenylmalonates of the formula III



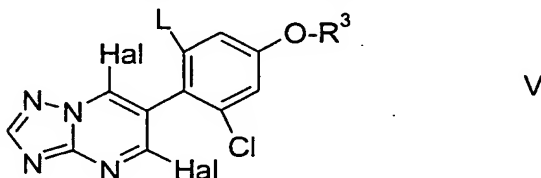


45

in which R is alkyl, to give dihydroxytriazolopyrimidines of the formula IV,



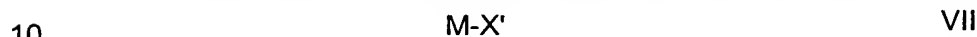
halogenation to give the dihalo compounds of the formula V



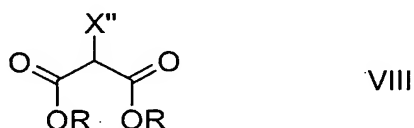
5 and reaction of V with amines of the formula VI



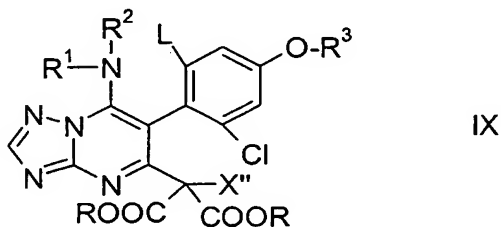
to give compounds of the formula I in which X is halogen, if desired, to prepare compounds I in which X is cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalkoxy, reaction of compounds I in which X is halogen with compounds of the formula VII



which, depending on the group X' to be introduced, are inorganic cyanides, alkoxylates or haloalkoxylates and in which M is an ammonium, tetra-alkylammonium, alkali metal or alkaline earth metal cation, and, if desired, to prepare compounds of the formula I according to claim 1 in which X is alkyl, by reaction of the compounds I in which X is halogen with malonates of the formula VIII,



in which X'' is hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl and R is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, to give compounds of the formula IX

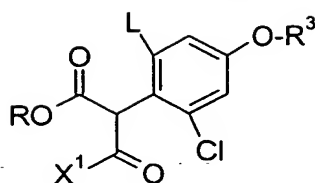


20 and decarboxylation to give compounds I in which X is alkyl.

8. A process for preparing the compounds of the formula I according to claim 1 in which X is C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl by reaction of 5-aminotriazole of the formula II according to claim 7 with keto esters of the formula IIIa,

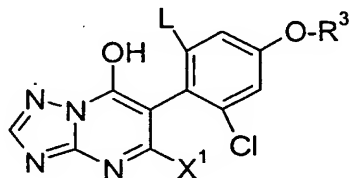
25

46



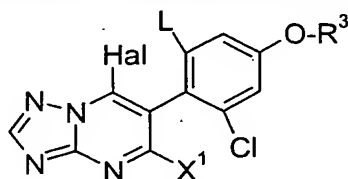
IIIa

in which X¹ is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give 5-alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines of the formula IVa



IVa

- 5 halogenation of IVa to give 7-halotriazolopyrimidines of the formula Va



Va

and reaction of Va with amines of the formula VI according to claim 7 to give compounds I.

- 10 9. A compound of the formulae IV, IVa, V or Va according to claims 7 and 8.
10. A fungicidal composition, comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to claim 1.
- 15 11. Seed, comprising 1 to 1000 g of a compound of the formula I according to claim 1 per 100 kg.
12. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I according to claim 1.
- 20